

PCT

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales Büro

AK

INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation ⁶ : A61K 31/565, 31/575	A1	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 95/13076
		(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 18. Mai 1995 (18.05.95)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/DE94/01309

(22) Internationales Anmeldedatum: 8. November 1994 (08.11.94)

(30) Prioritätsdaten:
P 43 38 314.9 10. November 1993 (10.11.93) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): JENAPHARM GMBH [DE/DE]; Patentabteilung, Otto-Schott-Strasse 15, D-07745 Jena (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): DROESCHER, Peter [DE/DE]; Trierer Strasse 18, D-99423 Weimar (DE). MENZENBACH, Bernd [DE/DE]; Otto-Schwarz-Strasse 4, D-07745 Jena (DE). PONSOLD, Kurt [DE/DE]; Thomas-Mann-Strasse 13 a, D-07743 Jena (DE). UNDEUTSCH, Bernd [DE/DE]; Spitzweidenweg 11, D-07743 Jena (DE). OETTEL, Michael [DE/DE]; Beethovenstrasse 30, D-07743 Jena (DE). RÖMER, Wolfgang [DE/DE]; Otto-Schwarz-Strasse 68 A, D-07745 Jena (DE). KAUFMANN, Günter [DE/DE]; Schillbachstrasse 41, D-07743 Jena (DE). SCHRÖDER, Jens [DE/DE]; Theobald-Renner-Strasse 15, D-07747 Jena (DE).

(74) Anwalt: CRAMER, Eva-Maria; Jenapharm GmbH, Patentabteilung, Otto-Schott-Strasse 15, D-07745 Jena (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: AU, BG, BR, CA, CN, CZ, FI, HU, JP, KP, KR, LK, MN, NO, NZ, PL, RO, RU, SK, UA, US, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).

Veröffentlicht

*Mit internationalem Recherchenbericht.**Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist. Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.*

(54) Title: USE OF STEROIDS WITH A PHENOLIC A-RING STRUCTURE FOR PROPHYLAXIS AND THERAPY OF RADICAL-MEDIATED CELL DAMAGE

(54) Bezeichnung: VERWENDUNG VON STEROIDEN MIT PHENOLISCHER A-RING-STRUKTUR ZUR PROPHYLAXE UND THERAPIE RADIKALVERMITTELTETER ZELLSCHÄDIGUNGEN

(57) Abstract

The present invention pertains to new pharmaceutical preparations for prophylaxis and therapy of radical-mediated cell damage, consisting of steroids with phenolic A-ring structure-except the estrogens estradiol, estrone, estrone and their 2-hydroxy derivatives as well as the steroids with cyclic substituents or with an amino group at the terminal C atom of the aliphatic C-17 side chain-and of pharmaceutical adjuvants. These preparations are characterized by a high-level inhibiting action against cell and tissue changes, such as lipid peroxidation and the oxidation of low density lipoprotein (LPL) cholesterol, caused by reactive oxygen species (ROS), free oxygen radicals and other forms of radical; these preparations thus prevent irreversible membrane and endothelial damage resulting therefrom. They therefore contribute to improving the prophylaxis and therapy of radical-induced damage such as that caused by oxygen radicals and/or ROS.

(57) Zusammenfassung

Die vorliegende Erfindung betrifft neue pharmazeutische Präparate zur Prophylaxe und Therapie radikalvermittelter Zellschädigungen, bestehend aus Steroiden mit phenolischer A-Ring-Struktur, ausgenommen die Estrogene Estradiol, Estron, Estrion und deren 2-Hydroxy-Derivate sowie die Steroide mit cyclischen Substituenten oder mit einer Aminogruppe am terminalen C-Atom der aliphatischen C-17-Seitenkette, und pharmazeutischen Hilfsstoffen. Diese Präparate zeichnen sich durch eine hohe Hemmwirkung auf die durch reaktive Sauerstoffspezies (ROS), freie Sauerstoffradikale und weitere Radikalformen ausgelösten Zell- und Gewebeveränderungen aus, wie beispielsweise die Lipidperoxidation und die Oxidation von Low Density Lipoprotein (LDL)-Cholesterol, und vermindern damit die dadurch bedingten irreversiblen Membran- und Endothelschädigungen. Sie tragen deshalb zu einer Verbesserung der Prophylaxe und Therapie radikalbedingter wie u.a. Sauerstoffradikal-bedingter und/oder durch ROS ausgelösten Schädigungen bei.

Best Available Copy